

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
3. Februar 2005 (03.02.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/010030 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **C07K 7/00**

Strasse 95, 13507 Berlin (DE). **SCHNATBAUM, Karsten**
[DE/DE]; Seumestrasse 8, 10245 Berlin (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: **PCT/EP2004/008057**

(74) **Anwalt: BOHMANN, Armin, K.**; Bohmann & Loosen,
Sonnenstrasse 8, 80331 München (DE).

(22) Internationales Anmeldedatum:
19. Juli 2004 (19.07.2004)

(81) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(25) Einreichungssprache: **Deutsch**

(26) Veröffentlichungssprache: **Deutsch**

(30) Angaben zur Priorität:
03016233.3 17. Juli 2003 (17.07.2003) **EP**

(71) **Anmelder** (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): **JERINI AG** [DE/DE]; Invalidenstrasse 130, 10115
Berlin (DE).

(72) **Erfinder; und**

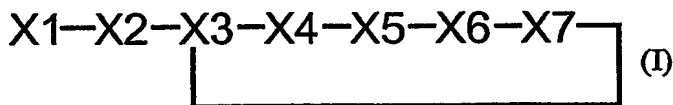
(75) **Erfinder/Anmelder** (nur für US): **HUMMEL, Gerd**
[DE/DE]; Pankstrasse 12, 13357 Berlin (DE). **LOCARDI,**
Elsa [DE/DE]; Wiciefstrasse 69, 10551 Berlin (DE).
POLAKOWSKI, Thomas [DE/DE]; Dunckerstrasse 29a,
10439 Berlin (DE). **SCHARN, Dirk** [DE/DE]; Berliner

(84) **Bestimmungsstaaten** (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT,
RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) **Title:** C5A RECEPTOR ANTAGONISTS

(54) **Bezeichnung:** C5a-REZEPTOR-ANTAGONISTEN



(57) **Abstract:** The invention relates to a C5a
receptor antagonist of structure (I), wherein
X1 is a radical having a mass of about 1-300
and stands for R5-, R5-CO-, R5-N(R6)-CO-,
R5-O-CO-, R5-SO₂-, R5-N(R6)-SO₂-,
R5-N(R6)-, R5-N(R6)-CS-, R5-N(R6)-
C(NH)-, R5-CS-, R5-P(O)OH-, R5-B(OH)-, or
R5-CH=N-O-CH₂-CO-, wherein R5/R6 represent H, F, hydroxy, alkyl, substituted alkyl, cycloalkyl, substituted cycloalkyl,
heterocyclyl, substituted heterocyclyl, arylalkyl, substituted arylalkyl, aryl, substituted aryl, heteroaryl, substituted heteroaryl, acyl,
substituted acyl, alkoxy, alkoxyalkyl, substituted alkoxyalkyl, aryloxyalkyl or substituted aryloxyalkyl; X2 = radical (biological
bonding properties of a mimicing phenylalanine unit); X3/X4 = spacer (amino acids, amino-acid analogs and amino-acid
derivatives); X5 = radical (biological bonding properties of a mimicing cyclohexylalanine or homoleucine unit); X6 = radical
(biological bonding properties of a mimicing tryptophan unit); X7 = radical (biological bonding properties of a mimicing
norleucine or phenylalanine unit), a chemical bond being formed between X3 and X7.

R5-CH=N-O-CH₂-CO-, wherein R5/R6 represent H, F, hydroxy, alkyl, substituted alkyl, cycloalkyl, substituted cycloalkyl,
heterocyclyl, substituted heterocyclyl, arylalkyl, substituted arylalkyl, aryl, substituted aryl, heteroaryl, substituted heteroaryl, acyl,
substituted acyl, alkoxy, alkoxyalkyl, substituted alkoxyalkyl, aryloxyalkyl or substituted aryloxyalkyl; X2 = radical (biological
bonding properties of a mimicing phenylalanine unit); X3/X4 = spacer (amino acids, amino-acid analogs and amino-acid
derivatives); X5 = radical (biological bonding properties of a mimicing cyclohexylalanine or homoleucine unit); X6 = radical
(biological bonding properties of a mimicing tryptophan unit); X7 = radical (biological bonding properties of a mimicing
norleucine or phenylalanine unit), a chemical bond being formed between X3 and X7.

(57) **Zusammenfassung:** C5a-Rezeptor-Antagonist, der Struktur (I), wobei X1 ein Radikal mit einer Masse von etwa 1-300 ist
und wobei X1 gleich R5-, R5-CO-, R5-N(R6)-CO-, R5-O-CO-, R5-SO₂-, R5-N(R6)-SO₂-, R5-N(R6)-, R5-N(R6)-CS-, R5-N(R6)-
C(NH)-, R5-CS-, R5-P(O)OH-, R5-B(OH)-, oder R5-CH=N-O-CH₂-CO-, wobei R5 / R6 gleich H, F, Hydroxy, Alkyl, substituier-
tes Alkyl, Cycloalkyl, substituiertes Cycloalkyl, Heterocyclyl, substituiertes Heterocyclyl, Arylalkyl, substituiertes Arylalkyl, Aryl,
substituiertes Aryl, Heteroaryl, substituiertes Heteroaryl, Acyl, substituiertes Acyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, substituiertes Alkoxyalkyl,
Aryloxyalkyl oder substituiertes Aryloxyalkyl, X2 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Phenylalanin-Einheit mimi-
krierend), X3 / X4 = Spacer (Aminosäuren, Aminosäure-Analoga und Aminosäure-Derivate), X5 = Radikal (biologische Bindungs-
eigenschaften einer Cyclohexylalanin- oder Homoleucin-Einheit mimikrierend), X6 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften
einer Tryptophan-Einheit mimikrierend), X7 = Radikal (biologische Bindungseigenschaften einer Norleucin- oder Phenylalanin-Ein-
heit mimikrierend), eine chemische Bindung zwischen X3 und X7 ausgebildet ist.

WO 2005/010030 A2



Veröffentlicht:

— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.